

СИНТЕЗ 1-АРИЛ- И 1-ГЕТАРИЛ-ЦИННОЛИН-4-ОНОВ

Сирый Д. Ю.¹, Савченко Т. И.²

¹ Харьковский национальный университет им. В.Н. Каразина

² Национальный фармацевтический университет
dmitriysiriy@mail.ru

Циннолины являются наименее исследованными представителями класса бензодиазинов. Отчасти это связано с трудностями их синтеза, отчасти, с малой доступностью необходимых исходных соединений.

В работе [1] был предложен удобный метод синтеза этил 1-арил-циннолин-4-он-3-карбоксилатов (7) (R=Ar) из этил о-фторбензоилацетата (3) и анилинов (4) (Рис. 1). Нами была модифицирована литературная методика, это позволило сократить время проведения заключительного превращения с 6ч до 1ч и повысить выходы циннолин-4-онов. В частности, вместо бутан-2-она в качестве среды для циклизации гидразонов (6) был использован ДМФА, а вместо K₂CO₃ были опробованы другие основания, была изменена и процедура выделения продуктов (7). Предложенный протокол был распространен на соли диазония (5) на основе аминокетероциклов, в результате был получен ряд новых 1-гетарил-циннолин-4-онов (7) (R=Het). Сложноэфирная группа в циннолин-4-онах (7) легко омылялась при нагревании в растворе NaOH (10%). Амидирование циннолин-4-он-3-карбоновых кислот в ДМФА с использованием КДИ приводило с высокими выходами к соответствующим амидам.

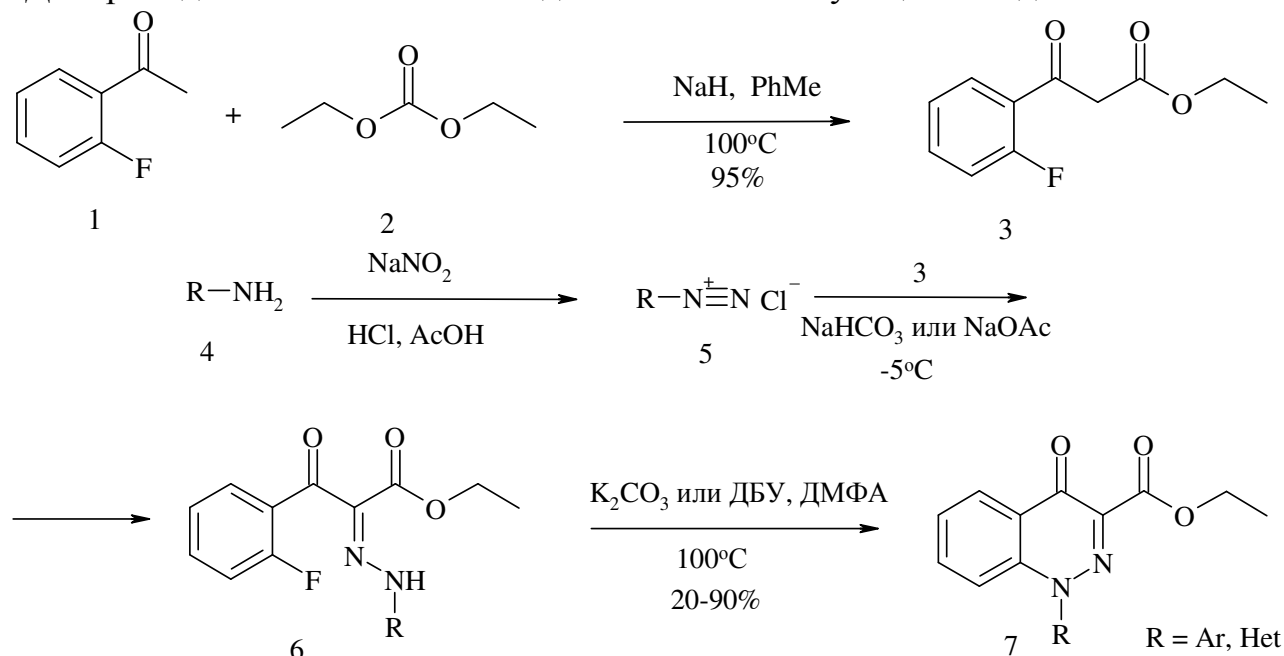


Рис 1. Схема синтеза этил циннолин-4-он-3-карбоксилатов

[1] D.E.Ames, O.T. Leung, A.G.Singh, *Synthesis* 1983(1), pp 52-53